Table-1

			Table-	· I			
	R <sup>3</sup> R <sup>2</sup> N N O R <sup>1</sup>						TPK1 IC50 (nM)
No.	R1	R2	R3	R4	R5	R6	
XA361	СН3-		Н	Н	Н	Н	18
XA364	СН3-		Н	Н	Н	Н	11
XA365	СН3-	<u></u>	H .	H·	Н	Н	22
XA366	СН3-	F-{\}_{\}_{\}_{\}	Н	Н	Н	Н	18
XA369	СН3-	CI →	Н	Н	Н	Н	9.6
XA370	СН3-	CI	H	н	н	Н	5.4
XA371	СН3-	C⊢ <u></u> _}-{	н	н	Н	Н	6.6
XA376	снз-	Br—{_}_{	Н	н	Н	Н	22
XA391	СН3-	OCH₃	Н	Н	Н	Н	1.8
XA392	СН3-	H <sub>3</sub> CQ	Н	Н	Н	Н	11
XA393	СН3-	H₃CO- <b>⟨</b> _>-	Н	Н	Н	н	4.7
XA396	СН3-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Н	н	H	Н	25
XA406	СН3-	NC-{\rightarrow}	Н	Н	Н	Н	15
XA433	СН3-	CN-C>-i	Н	н	н	Н	21

		R <sup>3</sup> R <sup>2</sup> N R <sup>1</sup>			-		TPK1 IC50 (nM)
No.	R1	R2	R3	R4	R5	R6	
XA439	СН3-	<b>€_N-{_}</b>	Н	н	Н	Н	13
XA442	СН3-	H₃CN_N-(_)	H	Н	Н	Н	2
XA463	СН3-	OCH <sub>3</sub> H₃CO	Н	Н	Н	н	2.2
XA464	СН3-	OCH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Н	4.7
XA468	СН3-	OCH <sub>3</sub>	Н	H .	Н	Н	0.9
XA470	СН3-	OCH <sub>3</sub> F————————————————————————————————————	Н	Н	H	Н	0.4
XA472	СН3-	OCH₃ F	Н	Н	Н	H .	5.5
XA480	CH3-		Н	н	н .	н	0.31
XA490	СН3-	CH <sub>3</sub> F—⟨¯}—;	Н	Н	Н	Н	24
XA501	СН3-	Bŕ	Н	Н	Н	Н	1.5
XA510	СН3-		Н	Н	Н	Н	2.5
XA511	СН3-	CN-C-OCH	H	Н	Н	Н	3.7
XA516	СН3-	F-CS-} F-F	Н	Н	Н	Н	2

	R <sup>3</sup> R <sup>2</sup> N N O R <sup>1</sup>						TPK1 IC50 (nM)
No.	R1	R2	R3	R4	R5	R6	
XA525	СН3-	OCH <sub>3</sub>	Н	Н	Н	Н	32
XA527	СН3-	H₃CO-<}-	}_ <b>}</b>	H	Н	Н	. 5
XA536	СН3-	F-(-)-{-};	Н	Н	Н	Н	1.6
XA543	СН3-		Н	H	Н	Н	1.2
XA544	CH3-		Н	Н	Н	Н	4.6
XA619	СН3-	Č.	Н	Н	Н .	Н	1.6
XA758	CH3~	OCH <sub>3</sub> F—()II-(	H ·	СНЗ	Н	Н	34
XA831	СН3-		Н	снз	Н	Н	15
XA1649	CH3-	OCH₃	H	Н	СН3-	СН3-	7.7

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XA1973		5.4
XA1974	O Company of the comp	13
XA1975		5.2
XA1976	CH CH CH	11
XA1978		. 4.3
XA1980	Ha H	12
XA1981	Hai Hai	14
XA1982	NG N	1.5

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XA1983	Coll Coll Coll Coll Coll Coll Coll Coll	18
XA1984	CH CH CH	4.8
XA1988	HC H	0.41
XA1989	NCI CHAIL NCI CHAIL	14
XA1990	HC HC HC HC HC	0.89
XA1991		1.5
XA1996		13
XA1998	CH CH CH	16

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XA1999	HO CH CH CH	17
XA2004	HCI CALL	8.3
XA2005	HCI	20
XA2006		2
XA2007	HCI HCI NA HCI N	1.8
XA2008		36
XA2011		5,4

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XA2012	HC TO BE	<b>4.4</b>
XA2013	HO HO HO HO HO	0.74
XA2014	HC HO HO	0.89
XA2015	H2 H	12
XA2016	HO	. 9
XA2017	100 Min	5.6
XA2018		13

No.	STRUCTURE	<u> </u>
		TPK1 IC50 (nM)
XA2019		0.64
XA2020		1.5
XA2021		1.9
XA2022		0.77
XA2023	CH CH CH,	6.2
XA2024	HO-(), CI, CI,	12
XA2025	Her Constitution of the Co	0.77
XA2026	4,c	14

No.	STRUCTURE	TD1//
		TPK1 IC50 (nM)
XA2027		0.85
XA2028		0.93
XA2029	tage	13
XA2030		6.9
XA2031	H,C , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	4.1
XA2032		2.5
XA2034		15

No.	STRUCTURE	l
	omooranz.	TPK1 IC50 (nM)
XA2035		-
·		1.2
XA2036		2
XA2037		10
XA2038		3.1
XA2039		4.8
XA2040		13
XA2041		5.1

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XA2042		4.1
XA2043	42~~~	19
XA2044		4.9
XA2045		1.7
XA2047		22
XA2048		1.5
XA2049	H,0-(1) - (1	9.8

		R <sub>3</sub> N N N R <sub>1</sub>				TPK1 IC50 (nM)
No	R1	R2	R3	R4	R5	
XB13	СН3-		H	Н	Н	13
XB16	СН3		Н	H	Н	19
XB17 -	СН3-		Н	Н	Н	5.3
XB19	CH3-	F-(-){	Н	Н	Н	24
XB33 •	CH3-	OCH <sub>3</sub>	Н	Н	н	2.7
XB35	СН3-	H <sub>3</sub> CO-{_}-{	Н	Н	Н	7.5
XB43	CH3-	O'Q,	H	н	Н	1.3
XB46	СН3-		Н	Н	H	1.8
XB47	CH3-	F-CON	Н	Н .	Н	8.8
XB48	СН3-	Q'N	Н	Н	Н	9.8
XB49	СН3-	ON ON	Н	Н	Н	0.78
XB127	СН3-	Н	Н		H	26
XB130	СН3-	н	Н	F-{}-{	Н	24
XB145	СН3-	н	Н	OCH₃	Н	33

:		R <sub>3</sub> N N R <sub>1</sub> R <sub>5</sub>			•	TPK1 IC50 (nM)
No	R1	R2	R3	R4	R5	
XB157	СН3-	Н	Н	P	H .	20
XB158	СН3-	Н	Н	FON	Н	11
XB159	CH3-	Н	Н	FON	Н	5.4
XB160	CH3-	Н	Н		Н	9.9
XB161	СН3-	H	Н		Н	5.6
XB162	CH3-	Н	Н		Н	15
XB164	СН3-	Н	Н	FON	Н	28
XB165	СН3-	H .	Н	O <sub>N</sub> λ ch₃	Н	42
XB168	СН3-	Н	Н	H <sub>3</sub> C O	H	41
XB169	CH3-	Н	Н		ОН	23

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XB256		. 1
XB257		7.5
XB258	CH CH	1
XB261		1.8
XB262	"COOPE	2.2
XB263	CBH	1.6
XB264		4.3
XB265		6.9

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XB266	COH CHI CHI	1.1
XB267		41
XB268		28
XB269	o o o o o o o o o o o o o o o o o o o	18
XB271	~~~~	13
XB272		36
XB273	No. A. C. C. C.	37
XB274		22

No.	STRUCTURE	
	-	TPK1 IC50 (nM)
XB275		25
XB276		6
XB277	a de la constant de l	25
XB278		29
XB283		3.1
XB284	NOT CH.	43
XB285		33
XB286		7.1
XB287	"" O O O O	0.98

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
XB288		1.4
XB292		1.1
XB301	OOG.	24

-	-	R <sup>3</sup> R <sup>2</sup> N N O R <sup>1</sup>			TPK1 IC50 (nM)
No.	R1	R2	R3	R4	
YA0262	CH3-	<b> →</b>	н	. Н	8.2
YA0263	CH3-	<b>₹</b>	Н	Н	12
YA0264	· CH3-	F-(	Н	H .	8.6
YA0267	CH3-	CI	Н	Н	2.6
YA0268	СН3-	CI.	н	Н	1.1
YA0269	CH3-	C⊢ <b>(</b> )—{	Н.	н	1.7
YA0274	CH3-	Br—{}-{	Н	Н	8.1
YA0289	CH3-	OCH₃	Н	н	1.8
YA0290	CH3-	H₃CQ	Н	Н	6.7
YA0291	CH3-	H <sub>3</sub> CO-{}-{	н	H <sub>.</sub>	3.5
YA0294	CH3-	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Н	Н	20
YA0304	CH3-	NC-{\rightarrow}-\{	٠Н	Н	7.4
YA0331	СН3-	Cn-<->-;	Н	Н	10
YA0337	CH3-	ON-(S)-1	Н	Н	7.4

$R^{3}$ $N$					TPK1 IC50 (nM)
No.	R1	R2	R3	R4	
YA0340	CH3-	H₃CN_N-{_}-{	Ĥ	H	. 1.2
YA0361	CH3-	OCH₃ → H₃CO	Н	Н	0.82
YA0362	CH3-	осн <sub>3</sub> Осн <sub>3</sub>	Н	Н	1.5
YA0366	СН3-	OCH3 F-√	Н	Н	0.72
YA0367	СН3-	OCH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub> one isomer of optical isomers	Н	Н	44
YA0368	СН3-	OCH <sub>3</sub> OCH <sub>3</sub> another isomer of optical isomers	Н	Н	0.25
YA0370	CH3-	OCH₃ C→ F	Н	H	1.4
YA0378	СН3-	CI—CI—S	Н	Н	1
YA0399	СН3-	OCH <sub>3</sub>	Н	Н	0.71
YA0408	CH3-	CN-{_}} CCH³	Н	Н	0.77
YA0409	CH3-	CN-C}-OCH3	Н	Н	1.8
YA0414	СН3-	OCH <sub>3</sub> F—C→↓ F	Н	H	1.7

		R <sup>3</sup> R <sup>2</sup> N N O R <sup>4</sup> -N R <sup>1</sup>			TPK1 IC50 (nM)
No.	R1	R2	R3	R4	
YA0423	CH3-	OCH <sub>3</sub>	Н	Н	15
YA0425	CH3-	H3CO-{_}-{_}-{	Н	н	2.4
YA0434	СН3-	F-()-()-{	Н	Н	3.4
YA0442	CH3-	CCT	Н	Н	2.5
YA0517	CH3-	Č.	Н	н	1.5
YA1339	СН3-	OCH <sub>3</sub> F-√√	Н	CH3-	26
YA1341	СН3-	OCH <sub>3</sub> F	Н	CH3-	34

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1534		7.8
YA1535	2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-2-	1.2
YA1536	CH CH N	26
YA1541		2.3
YA1542	CH CH	2
YA1544	Ha H	6.1
YA1545	Ha H	12

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1546	Ha H	0.86
YA1547		22
YA1548	HC HC HC HC	0.45
YA1549	HG HG HG	0.7
YA1550	Fig. Ha	1.1
YA1551	CH CH CH	11

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1552		14
YA1553	HCI CHANGE CONTRACTOR	2.1
YA1554	### ### ### ##########################	4.1
YA1555		5.4
YA1556		1.5
YA1557	2 2 2 3 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5 5	1.2
YA1558		.17

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1559	HO HO NO CH,	0.76
YA1560	H <sub>2</sub> C HCI HCI HCI HCI HCI HCI HCI HCI HCI HC	0.99
YA1561	HO HO HO OH,	7.6
YA1562	HO	4.3
YA1563	HO HO N HC HO OI,	5.1
YA1564	HG HG HG HG	2.3
YA1565	orand.	8

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1566		0.87
YA1567		1
YA1568		0.79
YA1569	HO-CA CALL.	5
YA1570	H <sub>2</sub> C C C C C C C C C C C C C C C C C C C	0.79
YA1571		4.4
YA1572		0.78

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1573		0.72
YA1574		4.8
YA1575		1.1
YA1576		1.8
YA1577		0.4
YA1578		8

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1579		1.7
YA1580		0.88
YA1581		3.2
YA1582		0.8
YA1583		2.2
YA1584		1.6
YA1585	Mc C	6.6

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YA1586		1.3
YA1587	H,C C C C C C C C C C C C C C C C C C C	0.68
YA1588		5.8
YA1589	H,M, C,	1.1
YA1590		4.3

$R_3$ $R_2$ $N$				TPK1 IC50 (nM)		
No.	R1	R2	R3	R4	R5	
YB13	СН3-		Н	Н	Н	15
· YB14	СН3-	Qui	Н	Н	Н	29.6
YB48	СН3-	ON,	Н	Н	Н	0.63
YB49	СН3-	P ON	Н	Н	Н	4
YB50	СН3-	Q.	Н	Н	Н	0.66
YB51	СН3-	ON ON	Н	H	Н	4.6
YB130	СН3-	Н	Н	F-(-){	Н	36
YB157	СН3-	Н	Н	FO	Н	14
YB162	СН3-	Н	Н		Н	5.8

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YB251	BOY.	10.4
YB252		8.8
YB253	P. J.	4.9
YB254	oog.	1.6
YB255	o'ant.	26
YB257	.004.	14
YB258		6
YB259		6.7

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YB260		18
YB261	Ho ho ho	20
YB262		11
YB263		7.4
YB264		2.7
YB266		0.59
YB267	No. The Contraction of the Contr	15
YB268		25

No.	STRUCTURE	TPK1 IC50 (nM)
YB269		5.2
YB270		0.54
YB271	No.	0.85
YB272		18
YB275		0.73
YB276		14
YB278	ofanj.	34